

特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 28 OCT 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 09570	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/09316	国際出願日 (日.月.年) 23.07.2003	優先日 (日.月.年) 23.07.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. ⁷ C07D213/64, 213/69		
出願人 (氏名又は名称) 株式会社クラレ		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
- ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)
- ☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b ☐ 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☐ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 13.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 01.10.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 渡辺 仁	4P 8213
電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- ☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
- ☐ PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう国際調査
- ☐ PCT 規則 12.4 にいう国際公開
- ☐ PCT 規則 55.2 又は 55.3 にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第 6 条 (PCT 14 条) の規定に基づき命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT 19 条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT 規則 70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)

請求の範囲 1-3

請求の範囲

有
無

進歩性(IS)

請求の範囲

請求の範囲 1-3

有
無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲 1-3

請求の範囲

有
無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1/WO 01/96308 A1

文献2/US 6169184 B1

文献3/Tetrahedron, Vol. 58, No. 22, 20 May 2002, p. 4429-4438

文献1は、本国際出願の明細書にも引用されている文献であって、製造方法2として、5-ハロー-2-アルコキシピリジンと複素環すず誘導体や複素環亜鉛誘導体のようなアリール化合物をパラジウム触媒を用いたカップリング反応に付し、5-アリール-2-アルコキシピリジン誘導体を製造し、さらに加水分解によりピリドン誘導体を製造する方法が記載されている。

文献2-3には、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を、有機マグネシウム化合物や有機亜鉛化合物と反応させることによるアリールクロスカップリング反応が記載されている。また、文献3には、触媒を用いない場合には、選択的にクロスカップリング反応が進行することが記載されている。

請求の範囲1-3に記載された製造方法のように、5-(2'-ピリジル)-2-ピリドン誘導体の製造方法において、2-ベンゼンスルホニルピリジン誘導体と有機マグネシウム化合物などの1族、2族と金属化合物とを反応させることによるアリールクロスカップリング反応を含む方法は、記載されていないから、請求の範囲1-3に記載された製造方法は、PCT第33条(2)に規定する新規性を有する。

しかし、遷移金属触媒を用いずにクロスカップリングを進行させる方法が文献2-3には記載されているから、文献1に記載の製造方法において、クロスカップリング工程として、文献2-3の記載に基づき、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を有機マグネシウム化合物と反応させる工程を採用することは、当業者が容易になし得る程度のことである。したがって、請求の範囲1-3に記載された製造方法は、PCT第33条(3)に規定する進歩性を有していない。

Rec'd PCT/PTO 21 JAN 2005

10/521800

PCT/JP2003/009316

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 09570	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/009316	International filing date (day/month/year) 23 July 2003 (23.07.2003)	Priority date (day/month/year) 23 July 2002 (23.07.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 213/64, 213/69		
Applicant KURARAY CO., LTD.		

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 3 sheets, including this cover sheet.
3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
 - a. ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of _____ sheets, as follows:
 - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
 - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
 - b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
4. This report contains indications relating to the following items:
 - ☒ Box No. I Basis of the report
 - ☐ Box No. II Priority
 - ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
 - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
 - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
 - ☐ Box No. VI Certain documents cited
 - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
 - ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 13 January 2004 (13.01.2004)	Date of completion of this report 01 October 2004 (01.10.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/009316

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☐ the description:

pages _____, as originally filed/furnished

pages* _____ received by this Authority on _____

pages* _____ received by this Authority on _____

☐ the claims:

pages _____, as originally filed/furnished

pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19

pages* _____ received by this Authority on _____

pages* _____ received by this Authority on _____

☐ the drawings:

pages _____, as originally filed/furnished

pages* _____ received by this Authority on _____

pages* _____ received by this Authority on _____

☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages _____

☐ the claims, Nos. _____

☐ the drawings, sheets/figs _____

☐ the sequence listing (*specify*): _____

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

☐ the description, pages _____

☐ the claims, Nos. _____

☐ the drawings, sheets/figs _____

☐ the sequence listing (*specify*): _____

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-3	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-3	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-3	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: WO, 01-96308, A1

Document 2: US, 6169184, B1

Document 3: Tetrahedron, 20 May, 2002 (20.05.02), Vol. 58, No. 22, pages 4429-4438

Document 1 is a document also cited in the specification of the present international application, and describes, as production process 2, a process for producing a pyridone derivative, comprising the steps of (1) subjecting a 5-halo-2-alkoxypyridine and an aryl compound such as a heterocyclic tin derivative or heterocyclic zinc derivative to a coupling reaction using a palladium catalyst, to produce a 5-aryl-2-alkoxypyridine derivative, and (2) further hydrolyzing it.

Documents 2 and 3 respectively describe an aryl cross-coupling reaction in which 2-benzenesulfonylpyridine or any of its derivatives is made to react with an organic magnesium compound or organic zinc compound. Furthermore, document 3 describes that if no catalyst is used, a cross-coupling reaction takes place selectively.

None of the above-mentioned documents describes a process for producing a 5-(2'-pyridyl)-2-pyridone derivative, including an aryl cross-coupling reaction in which a 2-benzenesulfonylpyridine derivative and a group 1 or group 2 metal compound such as an organic magnesium compound react with each other, though the production method described in claims 1-3 includes the reaction. So, the production process described in claims 1-3 appears to be novel, since it conforms to PCT Article 33 (2).

However, since documents 2 and 3 respectively describe a process for causing cross-coupling without using a transition metal catalyst, a person skilled in the art could have easily employed the process for letting 2-benzenesulfonylpyridine or any of its derivatives react with an organic magnesium compound based on the description of document 2 or 3 as a cross-coupling step in the production process described in document 1. Therefore, the production process described in claims 1-3 does not appear to involve an inventive step, since it does not conform to PCT Article 33 (3).